

昭47-13661

⑩ 特許公報

④ 公告 昭和47年(1972)4月24日

発明の数 1

(全2頁)

1

⑨ 新規なインドール-1-アルキルアミン誘導体
及びその塩の製造法

⑪ 特 願 昭43-87469

⑫ 出 願 昭43(1968)11月28日 5 れる。

⑬ 発 明 者 岡本忠士

芦屋市打出楠町7の2

同 小林強

箕面市桜ヶ丘4の9の17

同 山本久夫

西宮市川東町10の4

⑭ 出 願 人 住友化学工業株式会社

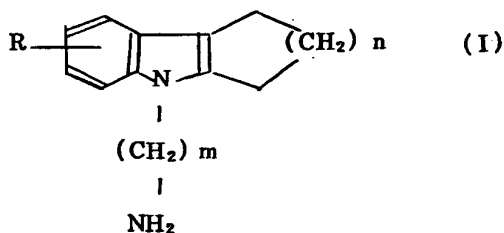
大阪市東区北浜5の15

代 理 人 弁理士 沢浦雪男

発明の詳細な説明

本発明は新規なインドール-1-アルキルアミン誘導体及びその塩の製造法に関するものである。

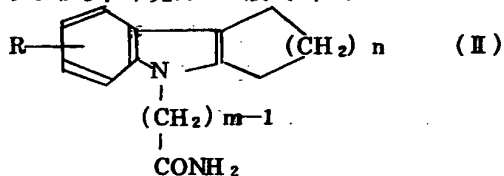
さらに詳しく言えば、一般式 (I)



(式中、Rは水素原子あるいはハロゲン原子を、
mは2を、及びnは1を意味する。)

であらわされる新規なインドール-1-アルキルアミン誘導体及びその塩の製造法に関するもので 30
ある。

すなわち、本発明は一般式 (II)



(式中、R, m及びnは前記と同じ意味を有する。)

であらわされるインドール-1-脂肪酸アミド誘導体を適当な還元剤で還元することにより行なわ

本発明の方法によつて得られるインドール-1-アルキルアミン誘導体及びその塩は文献未記載の新規化合物であり、それ自身中枢神経作用を有するとともに、さらに著効のある降圧剤、トラン
10 クライザーの合成中間体としてもきわめて有効である。

本発明の方法によつて得られるインドール-1-アルキルアミン誘導体は上述の如く、中枢神経作用を有するが、たとえばマウス、ラットなどの
15 実験小動物に10mg/Kg経口投与したときに自発運動量を30%以上抑制し、また50mg/Kg経口投与でカルジアゾール痙攣を抑制し、ヘキソバルビタールの顕著な増強効果を示す。

本発明の方法を実施するには、前記一般式

20 (II) であらわされるインドール-1-脂肪酸アミド誘導体を、たとえば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、ジエチレングリコールジメチルエーテル、その他不活性な溶媒の存在下、適当な還元剤、たとえば水素化リチウムアルミニウム、トリ-tert-ブトキシ水素化リチウムアルミニウム、ジエトキシ水素化リチウムアルミニウムなどの水素化アルミニウム化合物、水素化リチウムアルミニウム-塩化アルミニウムなどの混合水素化物などと処理
25 することにより行なわれる。反応は室温で円滑に進行するが、加温あるいは冷却してその反応速度を調節することができる。

本発明の方法によつてたとえば下記のインドール-1-アルキルアミン誘導体が製造される。

35 1-(2'-アミノエチル)-シクロペン

(b) インドール

1-(2'-アミノエチル)-5-クロロシ

3

4

クロベント (b) インドール

及びそれらの塩酸塩、硫酸塩、臭化水素酸塩、沃化メチル塩、酢酸塩、コハク酸塩、酒石酸塩などである。

次に実施例を挙げて本発明の方法をさらに詳しく説明するが、これはその一例にすぎないものであつてこれによつて何ら限定されないのはもちろんである。

実施例 1

1-シクロベント (b) インドリル-酢酸アミド 3.5 g のテトラヒドロフラン溶液 70 ml を、水素化リチウムアルミニウム 1.0 g とテトラヒドロフラン 15 ml の懸濁液に室温で加えて、後 6.5 時間攪拌還流させた。反応終了後、反応液を冷却し、水を徐々に加えて過剰の水酸化リチウムアルミニウムを分解し、無機物を分解後溶媒を完全に留去して 1-(2'-アミノエチル)-シクロベント (b) インドールを得た。

これをエーテルに溶解し、3 N 塩酸を加えると 1-(2'-アミノエチル)-シクロベント (b) インドール塩酸塩 3.0 g が得られた。

エタノールより再結晶すると融点 295 ~ 296 °C を示した。

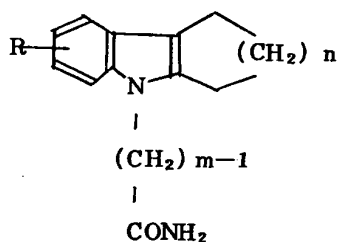
同様にして下記化合物を得た。

1-(2'-アミノエチル)-5-クロル-シクロベント (b) インドール塩酸塩

融点 283 ~ 287 °C (エタノール再結晶)

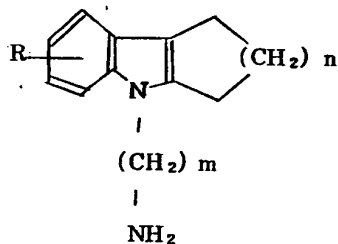
特許請求の範囲

1 一般式



(式中、R は水素原子あるいはハロゲン原子を m は 2 を、n は 1 を意味する。)

であらわされるインドール-1-脂肪酸アミド誘導体を還元することを特徴とする一般式



(式中、R, m 及び n は前記と同じ意味を有する。)

であらわされる新規なインドール-1-アルキルアミン誘導体及びその塩の製造法。

引用文献

特 公 昭 41-12307